

(19) 世界知的所有権機関  
国際事務局(43) 国際公開日  
2003 年 8 月 21 日 (21.08.2003)

PCT

(10) 国際公開番号  
WO 03/068776 A1(51) 国際特許分類: C07D 487/04,  
519/00, A61K 31/519, 31/5383, 31/5377, 31/542, A61P  
3/10, 9/00, 9/10, 25/16, 25/24, 25/28, 43/00

(21) 国際出願番号: PCT/JP03/01565

(22) 国際出願日: 2003 年 2 月 14 日 (14.02.2003)

(25) 国際出願の言語: 日本語

(26) 国際公開の言語: 日本語

(30) 優先権データ:  
特願2002-37819 2002 年 2 月 15 日 (15.02.2002) JP(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 協和  
醗酵工業株式会社 (KYOWA HAKKO KOGYO CO.,  
LTD.) [JP/JP]; 〒100-8185 東京都千代田区大手町一  
丁目 6 番 1 号 Tokyo (JP).

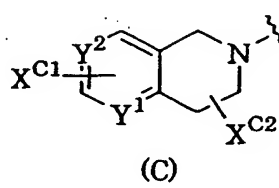
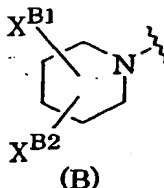
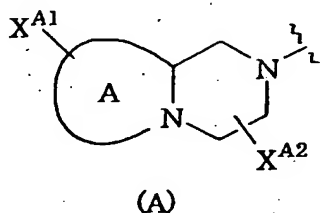
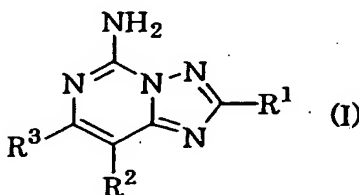
(72) 発明者: および

(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 因間 寛哲  
(IMMA, Hironori) [JP/JP]; 〒411-8731 静岡県駿  
東郡長泉町下土狩 1 1 8 8 協和醗酵工業株式  
会社 医薬総合研究所内 Shizuoka (JP). 渡邊 知一  
(WATANABE, Tomokazu) [JP/JP]; 〒411-8731 静岡県駿東郡長泉町下土狩 1 1 8 8 協和醗酵工業株  
式会社 医薬総合研究所内 Shizuoka (JP). 塩崎 静男  
(SHIOZAKI, Shizuo) [JP/JP]; 〒411-8731 静岡県駿東  
郡長泉町下土狩 1 1 8 8 協和醗酵工業株式会社 医  
薬総合研究所内 Shizuoka (JP). 神田 知之 (KANDA, To-  
moyuki) [JP/JP]; 〒411-8731 静岡県駿東郡長泉町下  
土狩 1 1 8 8 協和醗酵工業株式会社 医薬総合研究  
所内 Shizuoka (JP). 桑名 良寿 (KUWANA, Yoshihisa)  
[JP/JP]; 〒100-8185 東京都千代田区大手町一丁目  
6 番 1 号 協和醗酵工業株式会社 本社内 Tokyo (JP).  
島田 純一 (SHIMADA, Junichi) [JP/JP]; 〒411-8731 静  
岡県駿東郡長泉町下土狩 1 1 8 8 協和醗酵工業株  
式会社 医薬総合研究所内 Shizuoka (JP).(81) 指定国 (国内): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB,  
BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK,  
DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU,  
ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT,  
LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NO, NZ,  
OM, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, TJ,  
TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA,  
ZM, ZW.(84) 指定国 (広域): ARIPO 特許 (GH, GM, KE, LS, MW, MZ,  
SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア特許 (AM,

[続葉有])

(54) Title: [1,2,4]TRIAZOLO[1,5-c]PYRIMIDINE DERIVATIVES

(54) 発明の名称: [1,2,4]トリアゾロ[1,5-c]ピリミジン誘導体

(57) Abstract: [1,2,4]Triazolo[1,5-c]pyrimidine derivatives represented by the following general formula (I) or pharmacologically acceptable salts thereof which show an adenosine A<sub>2A</sub> receptor antagonism and are useful in treating and/or preventing various diseases caused by the hyperfunction of the adenosine A<sub>2A</sub> receptor: (I) wherein R<sup>1</sup> represents optionally substituted aryl or optionally substituted heteroaryl; R<sup>2</sup> represents hydrogen, halogeno, optionally substituted lower alkyl, optionally substituted aryl or optionally substituted heteroaryl; and R<sup>3</sup> represents a group of any of the following formulae (A), (B) and (C).

[続葉有])



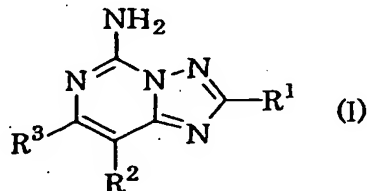
AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ特許 (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE, SI, SK, TR), OAPI 特許 (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

2文字コード及び他の略語については、定期発行される各PCTガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語のガイダンスノート」を参照。

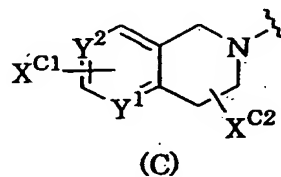
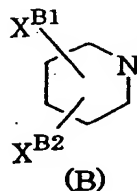
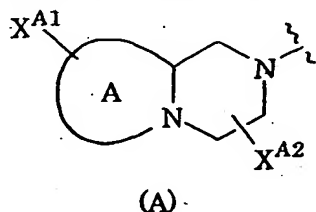
添付公開書類:

— 国際調査報告書

(57) 要約:



(式中、R<sup>1</sup>は置換もしくは非置換のアリールまたは置換もしくは非置換の芳香族複素環基を表し、R<sup>2</sup>は水素原子、ハロゲン、置換もしくは非置換の低級アルキル、置換もしくは非置換のアリールまたは置換もしくは非置換の芳香族複素環基を表し、R<sup>3</sup>は下記式 (A)、式 (B) または式 (C)



を表す)

アデノシンA<sub>2A</sub>受容体拮抗作用を示し、アデノシンA<sub>2A</sub>受容体の機能亢進に由来する各種疾患に対する治療および／または予防に有用な上記式 (I) で表される[1,2,4]トリアゾロ[1,5-c]ピリミジン誘導体またはその薬理上許容される塩を提供する。